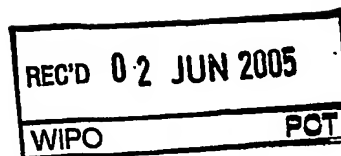


特許協力条約

PCT

特許性に関する国際予備報告 (特許協力条約第二章)

(法第 12 条、法施行規則第 56 条)
[PCT36 条及び PCT 規則 70]



出願人又は代理人 の書類記号 YCT-952	今後の手続きについては、様式 PCT/IPEA/416 を参照すること。	
国際出願番号 PCT/J P 2004/008211	国際出願日 (日.月.年) 11. 06. 2004	優先日 (日.月.年) 12. 06. 2003
国際特許分類 (IPC) Int.Cl. ⁷ C07D233/86, A61K31/4164, A61P5/28, 13/08, 17/02, 17/14, 35/00, 43/00		
出願人 (氏名又は名称) 中外製薬株式会社		

<p>1. この報告書は、PCT35 条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。 法施行規則第 57 条 (PCT36 条) の規定に従い送付する。</p> <p>2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で <u>3</u> ページからなる。</p> <p>3. この報告には次の附属物件も添付されている。</p> <p>a. <input checked="" type="checkbox"/> 附属書類は全部で <u>2</u> ページである。</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙 (PCT 規則 70.16 及び実施細則第 607 号参照)</p> <p><input type="checkbox"/> 第 I 欄 4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙</p> <p>b. <input type="checkbox"/> 電子媒体は全部で _____ (電子媒体の種類、数を示す)。 配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。 (実施細則第 802 号参照)</p> <p>4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第 I 欄 国際予備審査報告の基礎</p> <p><input type="checkbox"/> 第 II 欄 優先権</p> <p><input type="checkbox"/> 第 III 欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成</p> <p><input type="checkbox"/> 第 IV 欄 発明の単一性の欠如</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第 V 欄 PCT35 条 (2) に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明</p> <p><input type="checkbox"/> 第 VI 欄 ある種の引用文献</p> <p><input type="checkbox"/> 第 VII 欄 国際出願の不備</p> <p><input type="checkbox"/> 第 VIII 欄 国際出願に対する意見</p>	
---	--

国際予備審査の請求書を受理した日 09. 07. 2004	国際予備審査報告を作成した日 17. 05. 2005	
名称及びあて先 ・ 日本国特許庁 (IPEA/J P) 郵便番号 100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目 4 番 3 号	特許庁審査官 (権限のある職員) 渡辺 仁	4 P 8213
電話番号 03-3581-1101 内線 3492		

様式 PCT/IPEA/409 (表紙) (2004 年 1 月)

第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、_____ 語による翻訳文を基礎とした。
それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

- ☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査
☐ PCT規則12.4にいう国際公開
☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☐ 出願時の国際出願書類

☒ 明細書

第1-48 _____ ページ、出願時に提出されたもの

第 _____ ページ*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの

第 _____ ページ*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☒ 請求の範囲

第1-11, 13 _____ 項、出願時に提出されたもの

第 _____ 項*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの

第12 _____ 項*、08.04.2005 付で国際予備審査機関が受理したもの

第 _____ 項*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 _____ ページ/図、出願時に提出されたもの

第 _____ ページ/図*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの

第 _____ ページ/図*、 _____ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

☐ 明細書 第 _____ ページ

☐ 請求の範囲 第 _____ 項

☐ 図面 第 _____ ページ/図

☐ 配列表(具体的に記載すること) _____

☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) _____

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

☐ 明細書 第 _____ ページ

☐ 請求の範囲 第 _____ 項

☐ 図面 第 _____ ページ/図

☐ 配列表(具体的に記載すること) _____

☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) _____

* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性(N)	請求の範囲 1-13	有
	請求の範囲	無
進歩性(IS)	請求の範囲 1-13	有
	請求の範囲	無
産業上の利用可能性(IA)	請求の範囲 1-13	有
	請求の範囲	無

2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

文献1: JP 4-308579 A
文献2: JP 6-73017 A
文献3: JP 10-510845 A
文献4: JP 02-528434 A
文献5: JP 58-194891 A

先の国際調査報告で引用された上記文献1-3には、請求の範囲第1項-第13項記載の発明における「化1」として示された化合物に構造が類似した化合物が記載されているが、これらの文献には抗アンドロゲン剤の有する課題解決のための認識が記載されていないし、示唆もない。また上記文献4-5には、請求の範囲第12項記載の「化5」として示された化合物に構造が類似した化合物が記載されているが、これらの化合物を抗アンドロゲン剤製造方法における出発物質として使用することに関して、記載されていないし、示唆もない。

、ハロゲン原子、シアノ基、またはニトロ基であり；

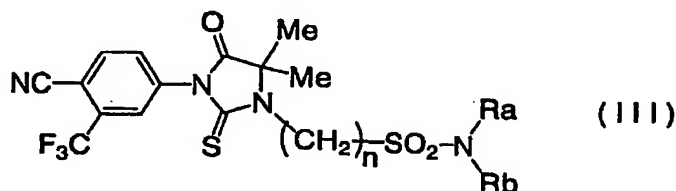
W^3 は、炭素数1～6の直鎖または分枝鎖状のアルキル基、炭素数1～6の直鎖または分枝鎖状のアルコキシ基、炭素数1～6の直鎖または分枝鎖状のアルキルアミノ基、炭素数1～6の直鎖または分枝鎖状のジアルキルアミノ基であり；

R^1 および R^2 は、請求項1で定義したとおりであり；

Rc は、炭素数1～6の直鎖または分枝鎖状のアルキル基である。]

で表される化合物を、4-シアノ-3-トリフルオロメチルフェニルイソチオシアネートと反応させ、式(III)

[化4]



[式中、 n 、 Ra 、および Rb は、既に定義したとおりである。]

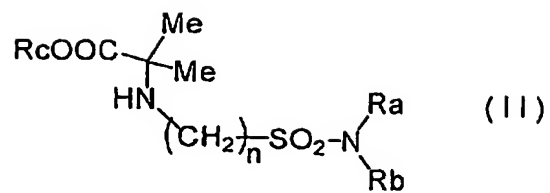
で表される化合物を得る工程、ならびに

Ra および Rb の少なくとも一方が、 R^1 および R^2 以外である場合は、脱保護の工程を含む前記方法。

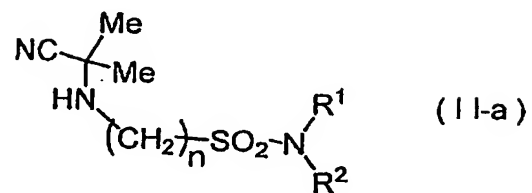
[12] (補正後)

式(II)または(II-a)

[化5]



または



[式中、n、Ra、RbおよびRcは、請求項11において定義したとおりであり、R¹およびR²は請求項1で定義したとおりである。]で表される化合物。

[13] 式(III)

[化6]

Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT/JP2004/008211



PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY (Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference YCT-952	FOR FURTHER ACTION See Form PCT/IPEA/416	
International application No. PCT/JP2004/008211	International filing date (day/month/year) 11 June 2004 (11.06.2004)	Priority date (day/month/year) 12 June 2003 (12.06.2003)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D 233/86, A61K 31/4164, A61P 5/28, 13/08, 17/02, 17/14, 35/00, 43/00		
Applicant CHUGAI SEIYAKU KABUSHIKI KAISHA		

- This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36.
- This REPORT consists of a total of 3 sheets, including this cover sheet.
- This report is also accompanied by ANNEXES, comprising:
 - ☒ (sent to the applicant and to the International Bureau) a total of 2 sheets, as follows:
 - ☒ sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions).
 - ☐ sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box.
 - ☐ (sent to the International Bureau only) a total of (indicate type and number of electronic carrier(s)) _____, containing a sequence listing and/or tables related thereto, in computer readable form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).
- This report contains indications relating to the following items:
 - ☒ Box No. I Basis of the report
 - ☐ Box No. II Priority
 - ☐ Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
 - ☐ Box No. IV Lack of unity of invention
 - ☒ Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
 - ☐ Box No. VI Certain documents cited
 - ☐ Box No. VII Certain defects in the international application
 - ☐ Box No. VIII Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 09 July 2004 (09.07.2004)	Date of completion of this report 17 May 2005 (17.05.2005)
Name and mailing address of the IPEA/JP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2004/008211

Box No. I Basis of the report

1. With regard to the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless otherwise indicated under this item.

- ☐ This report is based on translations from the original language into the following language _____, which is language of a translation furnished for the purpose of:
- ☐ international search (under Rules 12.3 and 23.1(b))
 - ☐ publication of the international application (under Rule 12.4)
 - ☐ international preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)

2. With regard to the elements of the international application, this report is based on *(replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report)*:

- ☐ The international application as originally filed/furnished
- ☒ the description:
- pages _____ 1-48 _____, as originally filed/furnished
- pages* _____ received by this Authority on _____
- pages* _____ received by this Authority on _____
- ☒ the claims:
- pages _____ 1-11, 13 _____, as originally filed/furnished
- pages* _____, as amended (together with any statement) under Article 19
- pages* _____ 12 _____ received by this Authority on _____ 08 April 2005 (08.04.2005)
- pages* _____ received by this Authority on _____
- ☐ the drawings:
- pages _____, as originally filed/furnished
- pages* _____ received by this Authority on _____
- pages* _____ received by this Authority on _____
- ☐ a sequence listing and/or any related table(s) – see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.

3. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/figs _____
- ☐ the sequence listing (*specify*): _____
- ☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): _____

4. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/figs _____
- ☐ the sequence listing (*specify*): _____
- ☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): _____

* If item 4 applies, some or all of those sheets may be marked "superseded."

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2004/008211

Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Statement

Novelty (N)

Claims

1-13

YES

Claims

NO

Inventive step (IS)

Claims

1-13

YES

Claims

NO

Industrial applicability (IA)

Claims

1-13

YES

Claims

NO

2. Citations and explanations (Rule 70.7)

Document 1: JP, 4-308579, A
Document 2: JP, 6-73017, A
Document 3: JP, 10-510845, A
Document 4: JP, 02-528434, A
Document 5: JP, 58-194891, A

Documents 1 through 3 cited in the ISR describe a compound having an analogous structure to the compound represented by the formula (1) of the invention described in claims 1 through 13 of the application; however, none of documents 1 through 3 describes or suggests knowledge required for solving the issues of anti-androgen drugs. Also, documents 4 and 5 describe a compound having analogous structure to the compound represented by the formula (5) described in claim 12 of the application; however, neither documents 4 or 5 describes or suggests using these compounds as a starting material in the production method for an anti-androgen drug.